

⑩日本国特許庁

⑪特許出願公開

公開特許公報

昭52—83581

⑫Int. Cl.² 識別記号

C 07 D 251/18

C 07 D 403/04

C 07 D 413/04 //

A 61 K 31/53

AAH

ABE

A 61 K 31/535

AAH

ABE

(C 07 D 403/04

C 07 D 251/18

C 07 D 295/12)

⑬日本分類

16 E 472

30 G 133.5

30 G 133.6

30 H 111.5

30 H 22

庁内整理番号

7431—44

6617—44

6617—44

5921—44

5921—44

⑭公開 昭和52年(1977)7月12日

発明の数 1

審査請求 未請求

(全 8 頁)

⑮2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-
ートリアジン類およびその酸付加塩

八王子市片倉町888番地の10

⑯出 願 人 三菱化成工業株式会社

東京都千代田区丸の内二丁目5

番2号

⑰特 願 昭51—210

⑱出 願 昭51(1976)1月1日

⑲発 明 者 角田勝

⑳代 理 人 弁理士 長谷川一 外1名

最終頁に続く

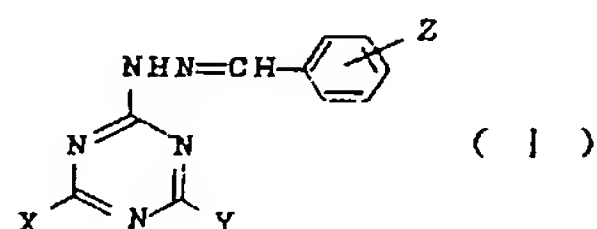
明 細 書

1 発明の名称

2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-
ートリアジン類およびその酸付加塩

2 特許請求の範囲

下記一般式(I)



(上記一般式(I)中で、Xは炭素数10以下の低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基またはアリール基を表わし、Yは、アミノ基、炭素数10以下のアルキルアミノ基もしくはジアルキルアミノ基、モルホリノ基、ノ-ビペラジニル基、4位が炭素数10以下のアルキル基、6-ヒドロキシアルキル基、アシル基もしくはアリール基で置換されたノ-ビペラジニル基またはベンザルヒドラジノ基を表わし、Zは水素原子、ハロゲン原子、炭素数10以下のアルコ

キシ基またはスルホ基を表わす。)

で表わされる2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-ートリアジン類およびその酸付加塩。

3 発明の詳細な説明

本発明は、2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-ートリアジン類およびその酸付加塩に関する。

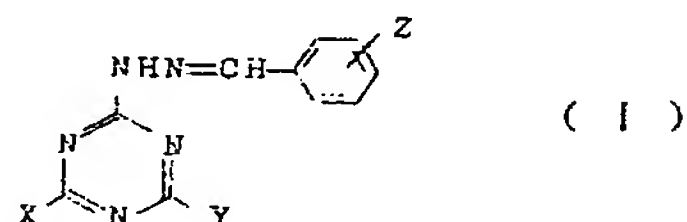
さらに詳しくは、本発明は鎮痛および抗炎症作用を有する新規な2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-ートリアジン類およびその酸付加塩に関する。

従来、鎮痛抗炎症作用を有する薬物としてはアミノピリン、メピリゾール、メフェナム酸等が知られているが、本発明者らはさらに強い鎮痛抗炎症作用を有する化合物を検索した結果、2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-ートリアジン類に強い鎮痛抗炎症作用を見出し本発明を完成するに至った。

本発明の目的は強い鎮痛抗炎症作用を有する2, 4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-

トリアジン類を提供することにある。

本発明を詳細に説明すると、本発明化合物は下記一般式(Ⅰ)で表わされる。



上記一般式(Ⅰ)中で、Xは炭素数10以下の低級アルキル基、ハロゲン化低級アルキル基またはアリール基を表わし、Yはアミノ基、炭素数10以下のアルキルアミノ基、もしくはジアルキルアミノ基、モルホリノ基、ノービペラジニル基、4位が炭素数10以下のアルキル基、6-ヒドロキシアルキル基、アシル基もしくは、アリール基で置換されたノービペラジニル基またはベンザルヒドラジノ基を表わし、Zは水素原子、ハロゲン原子、炭素数10以下のアルコキシ基またはスルホ基を表わす。

さらに具体的には、Xはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル

ノービペラジニル基等の4-置換ノービペラジニル基またはベンザルヒドラジノ基を表わし、Zは水素原子；塩素、臭素、フッ素原子等のハロゲン原子；メトキシ基、エトキシ基等のアルコキシ基またはスルホ基を表わす。

また、Zの具体例としてはo-クロロ基、m-クロロ基、p-クロロ基、o-メトキシ基、m-メトキシ基、p-メトキシ基、o-エトキシ基、m-エトキシ基、o-スルホ基、m-スルホ基、p-スルホ基等があげられる。

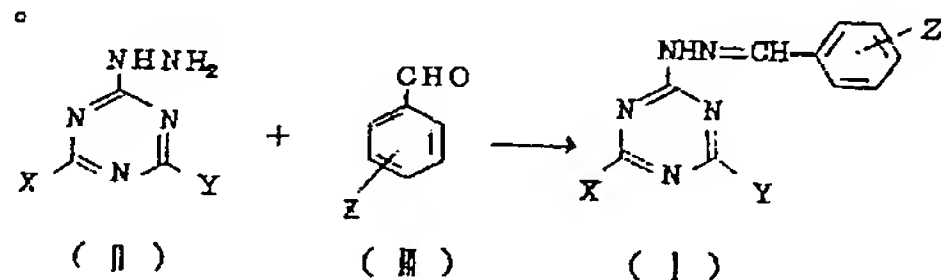
また、2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類の酸付加塩としては、塩化水素酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸、酢酸、クエン酸、マレイン酸、コハク酸、乳酸、酒石酸、グルコン酸、安息香酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の酸付加塩が挙げられる。

本発明化合物である2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類およびその

特開 昭52-93581(2)

基、イソブチル基、t-ブチル基等のアルキル基；モノクロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、モノフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、モノクロロエチル基、ジクロロエチル基、トリクロロエチル基等のハロゲン化アルキル基またはフェニル基、ナフチル基等のアリール基を表わし、Yはアミノ基；メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、t-ブチルアミノ基等のアルキルアミノ基；ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等のジアルキルアミノ基；モルホリノ基；ノービペラジニル基；2-メチルノービペラジニル基、4-エチルノービペラジニル基、4-ヒドロキシメチルノービペラジニル基、4-(2-ヒドロキシエチル)ノービペラジニル基、4-アセチルノービペラジニル基、4-プロピオニルノービペラジニル基、4-フェニルノービペラジニル基、4-ナフチルノー

酸付加塩は種々の方法で製造されるが、以下に下記反応式で表わされる製造法について説明する。



(上記反応式中でX、YおよびZは上記一般式(Ⅰ)で定義したとおりである。)

すなわち、上記一般式(Ⅱ)で表わされる、2,4-ジ置換-6-ヒドラジノ-8-トリアジンと上記一般式(Ⅲ)で表わされるベンズアルデヒド類を反応させて、上記一般式(Ⅰ)で表わされる2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類およびその酸付加塩を製造することができる。

上記反応でベンズアルデヒド類(Ⅲ)は2,4-ジ置換-6-ヒドラジノ-8-トリアジン(Ⅱ)に対し当量以上使用されるが、反応速度を高め有利に反応を進めるにはベンズアルデヒド類

を過剰使用することが望ましく、通常1.1～1.5倍モル使用される。

反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じてメタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、水等の溶媒を使用することができる。

一般に反応は、2,4-ジ置換-6-ヒドラジノ-8-トリアジンまたはその溶液と当モル以上のベンズアルデヒドを混合攪拌し、室温で放置するかまたは約100℃までの温度に加熱して行われる。

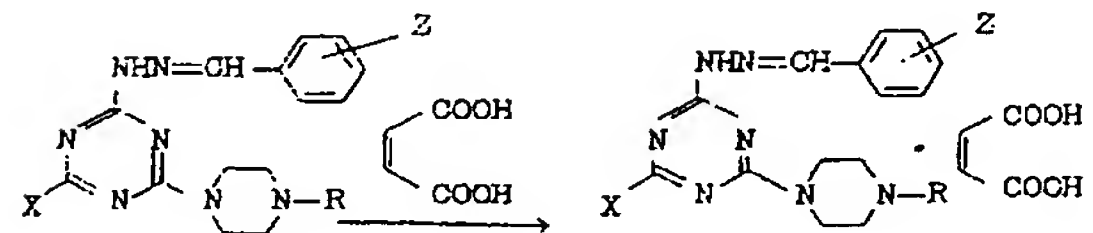
反応時間は使用する2,4-ジ置換-6-ヒドラジノ-8-トリアジンの種類によつて異なるが数分から数十時間の範囲から選ばれる。

反応終了後析出する結晶または使用した溶媒を留去後析出する結晶を分別し適当な溶媒たとえばエタノールから再結晶して精製する。

トリアジン環の置換基の1つであるYがノービペラジニル基である2-置換-4-(ノービ

特開 昭52-83581 (A)

ペラジニル)-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類は次式のようにしてマレイン酸塩に導くことができる。



上記反応式中でXおよびZは上記一般式(1)におけると同じ意義を有し、Rは水素原子、炭素数10以下のアルキル基、もしくはアシル基、またはフェニル基等を表わす。

上記反応はメタノール、エタノール等のアルコール中、当モルのマレイン酸を用いて室温～50℃の温度で、数分から数時間行われる。反応終了後析出する結晶を適当な溶媒たとえばメタノールを用いて再結晶することにより精製する。

次に本発明化合物である2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類の薬理

作用(鎮痛活性)をd,d系雄性マウスを用いてアミノピリンおよびメピリゾールと比較して測定した。その測定方法は下記のとおりである。

酢酸よじり運動(writhing)に対する抑制効果
0.6g酢酸0.1ml/10gの腹腔内投与により誘発されるよじり運動の回数を20分間測定した。薬物は試験の30分前に経口投与し、ED₅₀はコントロール群のよじり運動を50%抑制する用量とした。

尾根部加圧法による鎮痛効果の測定

加圧装置により尾根部に圧を加え、もがき、泣鳴、加圧子に対するかみつきの見られた時の閾値を測定し、正常閾値とした。薬物を投与(経口投与)して30分後に閾値を測定し、正常閾値を1.5倍以上に上昇した場合鎮痛効果ありとしてED₅₀を求めた。

電気刺激法による鎮痛効果の測定

尾根部に双極性白金電極を装置し、電気刺激装置により40V、20 msec、1 Hzの矩形波刺激を与えたときの泣鳴(Vocalization)を指標

とした。正常時の反応を5回測定し、泣鳴をおこすまでの時間を平均反応時間とした。薬物投与後10分間隔で60分まで刺激を与え、10分間以上にわたつて平均反応時間を2倍以上に延長した場合を有効としED₅₀を求めた。試験化合物のLD₅₀を含め、その結果を下記表-1に示す。

なお、表-1中で2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類は表中の一般式中のX、YおよびZを特定することにより表わす。

また、2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類の抗炎症効果を下記方法で測定した。

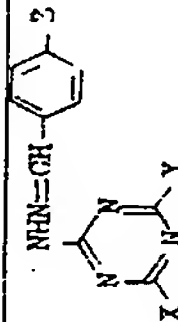


すなわちカラゲニン足浮腫に対する抑制効果をウインターらの定法に従って測定した。

体重120g前後の雄ウイスター系ラット10匹を1群とし用いた。前日より絶食させ、1.5%カラゲニン0.1mlを後肢足に皮下注射する30分前に被験薬物を経口投与した。カラゲニン注射前と3時間後における後肢足の重量を測定し浮腫強度を求めED₅₀は浮腫強度を50%抑制する用量とした。結果を表-2に示す。

比較例としてメフェナム酸およびアミノピリンの抗炎症効果を表-2に示す。

なお、表-2中で2,4-ジ置換-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン類は表中の一般式中のX、YおよびZを特定することにより表わす。

表 - 1

| No. |  | | | 浮腫抑制効果 ED ₅₀ (mg/kg) P.O. | 浮腫抑制効果 ED ₅₀ (mg/kg) P.O. | 浮腫抑制効果 ED ₅₀ (mg/kg) P.O. | LD ₅₀ (mg/kg) i.p. |
|-----|---|--|--------------------|---|---|---|-------------------------------------|
| | Y | Y | Z | | | | |
| 1 | -C(CH ₃) ₃ | -N  | H | 54 | 90 | 215 | 860 |
| 2 | -(CH ₂) ₃ CH ₃ | " | " | 80 | 100 | 260 | 1000以上 |
| 3 | -CPh ₃ | " | " | 25 [※] | 50 [※] | - | 1000以上 |
| 4 | " | -N  | -SO ₃ H | 20 [※] | 150 [※] | - | 1000以上 |
| 5 | " | イピリソ | -ル | 56 | 125 | 245 | 700 |
| 6 | イミノピリン | | | 42 | 130 [※] | 250 | 270 |

* : 腹腔内投与

表 - 2

| No. | 化学構造 | カラゲニン足 浮腫抑制 ED ₅₀ (mg/kg) P.O. |
|-----|--------|---|
| 1 | | 25 |
| 2 | | 28 |
| 3 | | 40 |
| 4 | | 35 |
| 5 | | 40 |
| 6 | メフェナム酸 | 42 |
| 7 | アミノピリン | 75 |

次に本発明化合物の製造方法を実施例にて具体的に説明するが、本発明に包含される化合物は、本発明の要旨を超えない限り以下の実施例により合成された化合物に限定されるものではない。

実施例 1

2-(4-フェニル)-4-(1-ピペラジニル)-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジンの合成

2-(4-フェニル)-4-(1-ピペラジニル)-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジン1.71g (6.8 mmol)とベンズアルデヒド794mg (7.49 mmol)とをベンゼン30ml中で2時間還流し、ベンゼン留去後得られる結晶を酢酸エチルより再結晶して、2-(4-フェニル)-4-(1-ピペラジニル)-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジンを得る。

収量1.52g (66.7%)、融点166~168℃

元素分析：C₂₄H₂₅N₇として

| | C | H | N |
|--------|-------|------|-------|
| 計算値(%) | 63.69 | 7.42 | 28.89 |
| 実験値(%) | 63.75 | 7.53 | 28.69 |

実施例 2

2-(4-フェニル)-4-(1-ピペラジニル)-6-ベンザルヒドラジノ-8-トリアジンの合成

ル) - 6 - ベンザルヒドラジノ - 8 - トリアジ
ンの合成

2 - (n-ブチル) - 4 - (ノ-ビペラジニ
ル) - 6 - ヒドラジノ - 8 - トリアジン 1.26
g (5 mmol) とベンズアルデヒド 5.83 g
(5.5 mmol) とをメタノール 10 ml に溶かし、
湯浴上で 10 分間加熱する。

メタノールを留去して生じる結晶をシクロヘ
キサンより再結晶して、2 - (n-ブチル) -
4 - (ノ-ビペラジニル) - 6 - ベンザルヒド
ラジノ - 8 - トリアジンを得る。

収量 760 mg (44.8%)、融点 148 ~
151 °C

元素分析: $C_{21}H_{28}N_6$ として

| | C | H | N |
|--------|-------|------|-------|
| 計算値(%) | 63.69 | 7.42 | 28.89 |
| 実験値(%) | 63.85 | 7.49 | 28.76 |

実施例 3

2 - メチル - 4 - (ノ-ビペラジニル) - 6 -
ベンザルヒドラジノ - 8 - トリアジンのマレ

2 - トリフルオロメチル - 4 - (ノ-ビペラ
ジニル) - 6 - ヒドラジノ - 8 - トリアジン
2.66 g (7.57 mmol) とベンズアルデヒド
8.82 g (8.32 mmol) とをベンゼン 30 ml 中
で 3 時間還流し、ベンゼン留去後、得られる結
晶をエタノールから再結晶して、2 - トリフル
オロメチル - 4 - (ノ-ビペラジニル) - 6 -
ベンザルヒドラジノ - 8 - トリアジンを得る。

収量 1.40 g (52.6%)、融点 202 ~
204 °C。

元素分析: $C_{17}H_{14}N_6F_3$ として

| | C | H | N | F |
|--------|-------|------|-------|-------|
| 計算値(%) | 51.28 | 4.59 | 27.91 | 16.22 |
| 実験値(%) | 51.14 | 4.61 | 27.89 | 16.53 |

次に得られた 2 - トリフルオロメチル - 4 -
(ノ-ビペラジニル) - 6 - ベンザルヒドラジ
ノ - 8 - トリアジン 8.78 g (2.5 mmol) をマ
レイン酸 2.90 g (2.5 mmol) のメタノール溶
液に加え、湯浴上で 5 分間加熱し、生じた結晶
をエタノールから再結晶してマレイン酸塩を得

イン酸塩の合成

2 - メチル - 4 - (ノ-ビペラジニル) - 6 -
ヒドラジノ - 8 - トリアジン 6.27 g (3
mmol) とベンズアルデヒド 3.50 g (3.3 mmol)
とをメタノール 10 ml に溶かし、一夜放置する。
これにマレイン酸 3.48 g (3 mmol) を加えて
放置し、生じる結晶をメタノールより再結して、
2 - メチル - 4 - (ノ-ビペラジニル) - 6 -
ベンザルヒドラジノ - 8 - トリアジンのマレイ
ン酸塩を得る。

収量 560 mg (45.2%)、融点 179 ~
181 °C

元素分析: $C_{19}H_{23}O_4N_6$ として

| | C | H | N |
|--------|-------|------|-------|
| 計算値(%) | 55.19 | 5.61 | 23.72 |
| 実験値(%) | 54.36 | 5.77 | 23.37 |

実施例 4

2 - トリフルオロメチル - 4 - (ノ-ビペラ
ジニル) - 6 - ベンザルヒドラジノ - 8 - トリ
アジンおよびそのマレイン酸塩の合成

る。

収量 1.13 g (96.3%)、融点 172 ~
174 °C。

元素分析: $C_{19}H_{17}O_4N_6F_3$ として

| | C | H | N | F |
|--------|-------|------|-------|-------|
| 計算値(%) | 48.82 | 4.31 | 20.98 | 12.19 |
| 実験値(%) | 48.57 | 4.46 | 20.80 | 11.82 |

実施例 5

2 - トリフルオロメチル - 4 - モルホリノ
6 - (4-スルホベンザルヒドラジノ) - 8 -
トリアジンの合成

2 - トリフルオロメチル - 4 - モルホリノ
6 - ヒドラジノ - 8 - トリアジン 7.92 g (3
mmol) をメタノール 15 ml に溶かし、p-ホル
ミル - ベンゼンスルホン酸ナトリウム 7.49 g
(3.6 mmol) を加え湯浴上で 10 分間加熱する。
生ずる結晶をろ別し、少量の水に溶かし、濃塩
酸を加えて酸性にする。再び生じた結晶をろ別
し、エタノールで洗浄すると 2 - トリフルオロ
メチル - 4 - モルホリノ - 6 - (4-スルホベ

ンヒドラジノ)ー8ートリアジンが得られ2
る。

収量720mg(55.6%)、融点300℃
以上。

元素分析： $C_{15}H_{10}O_4N_4P_3S$ として

| | C | H | N | P |
|--------|-------|------|-------|-------|
| 計算値(%) | 41.65 | 3.52 | 19.43 | 13.18 |
| 実験値(%) | 41.49 | 3.61 | 19.42 | 13.07 |

実施例6

2ートリフルオロメチルー4ー(1ービペラ
ジニル)ー6ー(4ーメトキシベンザルヒドラ
ジノ)ー8ートリアジンのマレイン酸塩の合成

2ートリフルオロメチルー4ー(1ービペラ
ジニル)ー6ーヒドラジノー8ートリアジン
1.338とpーメトキシベンズアルデヒド2ml
とをエタノール20mlに加えて、2時間加熱還
流し溶媒留去後残った半固体をメタノール10
mlに溶かしマレイン酸600mgを加えて水浴上
で5分間加熱し、室温に放置すると結晶が析出
する。これをエタノールから再結晶して、2ー

6ーベンザルヒドラジノー8ートリアジンの結
晶が析出する。

収量330mg(20%)、融点181~183℃

元素分析： $C_{20}H_{14}N_4$ として

| | C | H | N |
|--------|-------|------|-------|
| 計算値(%) | 66.83 | 5.89 | 27.28 |
| 実験値(%) | 66.60 | 5.01 | 26.82 |

実施例8

2ートリフルオロメチルー4ー(4ーアセチ
ルー1ービペラジニル)ー6ー(4ークロロベ
ンザルヒドラジノ)ー8ートリアジンの合成

2ートリフルオロメチルー4ー(4ーアセチ
ルー1ービペラジニル)ー6ーヒドラジノー8
ートリアジン620mg(2.03mmol)とpーク
ロロベンズアルデヒド430mg(3.04mmol)
とをベンゼン20ml中湯浴上で5分間加熱し、
室温にて3時間放置し、溶媒留去後生ずる結晶
を熱エタノールで洗うと2ートリフルオロメチ
ルー4ー(4ーアセチルー1ービペラジニル)
ー6ー(4ークロロベンザルヒドラジノ)ー8

特開 昭52-83581 (uj)

トリフルオロメチルー4ー(1ービペラジニル)

ー6ー(4ーメトキシベンザルヒドラジノ)ー

8ートリアジンのマレイン酸塩を得る。

収量740mg(29.4%)、融点198~
200℃。

元素分析： $C_{20}H_{14}O_4N_4P_3S$ として

| | C | H | N | P |
|--------|-------|------|-------|-------|
| 計算値(%) | 48.29 | 4.46 | 19.71 | 11.46 |
| 実験値(%) | 48.60 | 4.68 | 20.12 | 11.94 |

実施例7

2ーフェニルー4ー(1ービペラジニル)ー
6ーベンザルヒドラジノー8ートリアジンの合
成

2ーフェニルー4ー(1ービペラジニル)ー
6ーヒドラジノー8ートリアジン1.138
(4.17mmol)とベンズアルデヒド480mg
(4.6mmol)とをベンゼン20ml中2時間加熱
還流し、溶媒留去後残渣に水、エタノールをほ
ぼ等量加えて、加熱し可溶部を室温に放置する
と2ーフェニルー4ー(1ービペラジニル)ー

8ートリアジンが得られる。

収量866mg(100%)、融点260℃以
上。

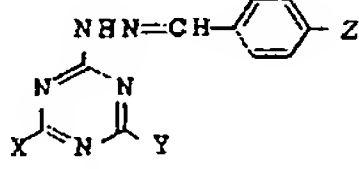

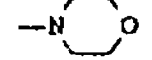
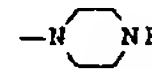

元素分析： $C_{17}H_{10}ON_4Cl_2$ として

| | C | H | N | P | Cl |
|--------|-------|------|-------|-------|------|
| 計算値(%) | 47.72 | 4.01 | 22.92 | 13.32 | 8.24 |
| 実験値(%) | 47.80 | 4.02 | 22.75 | 13.60 | 8.54 |

その他各種の2,4ージ置換ー6ーベンザルヒ
ドラジノー8ートリアジン類を上記実施例に従
って合成した。

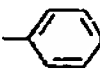
結果を上記実施例の結果と併せて表-3に示
す。なお、表-3で2,4ージ●置換ー6ーベン
ザルヒドラジノー8ートリアジン類は一般式中
のX、YおよびZを特定することによつて表わ
す。

表 - 3

| No | <div></div> | | | 合成法 (実施例 No) | 収 率 (%) | 融 点 (°C) | 元 素 分 析 値 (例) | | | |
|----|--|---|------------------------|--------------------|------------|----------|----------------|--------------|----------------|----------------|
| | 計 算 値 (欄上部の値) | | | | | | | | | |
| | 実 験 値 (欄下部の値) | | | | | | | | | |
| | X | Y | Z | | | | C | H | N | F |
| 1 | $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$ |  | H | 1 | 66.7 | 166~168 | 63.69 63.75 | 7.42 7.53 | 28.89 28.69 | — — |
| 2 | $-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$ | # | # | 2 | 44.8 | 148~151 | 63.69 63.85 | 7.42 7.49 | 28.89 28.76 | — — |
| 3 | $-\text{CH}_3$ | # | # | 3 | 45.2 | 179~181 | 55.19 54.36 | 5.61 5.77 | 23.72 23.37 | — — |
| 4 | $-\text{CF}_3$ | # | # | 4 | 52.6 | 202~204 | 51.28 51.14 | 4.59 4.61 | 27.91 27.89 | 16.22 16.53 |
| 5 | # |  | $-\text{SO}_3\text{H}$ | 5 | 55.6 | 300以上 | 41.65 41.49 | 3.52 3.61 | 19.43 19.42 | 13.18 13.07 |
| 6 | # |  | $-\text{OCH}_3$ | 6 | 29.4 | 198~200 | 48.29 48.60 | 4.46 4.68 | 19.71 20.12 | 11.46 11.94 |
| 7 |  | # | H | 7 | 21 | 181~183 | 66.83 66.60 | 5.89 6.01 | 27.28 26.82 | — — |

[字別]

| No | X | Y | Z | 合成法 (実施例No) | 収率 (%) | 融点 (°C) | C | H | N | F |
|----|----------------|--|------------------------|----------------|-----------|---------|----------------|--------------|----------------|----------------|
| 8 | $-\text{CF}_3$ | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{NCOCH}_3 \diagdown \end{array}$ | Cl | 8 | 100 | 260以上 | 47.72 47.80 | 4.01 4.02 | 22.92 22.75 | 13.32 13.60 |
| 9 | " | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{O} \diagdown \end{array}$ | H | 1 | 78 | 199~200 | 51.63 51.32 | 4.29 4.57 | 23.86 23.80 | 16.18 16.34 |
| 10 | " | " | $-\text{SO}_3\text{H}$ | 5 | 88 | 250以上 | 47.61 47.67 | 4.79 4.85 | 22.21 22.29 | 8.47 8.33 |
| 11 | " | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{NH} \diagdown \end{array}$ | Cl | 4 | 51 | 265以上 | 46.70 45.83 | 3.92 4.21 | 25.42 25.76 | 14.77 14.63 |
| 12 | " | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{N}(\text{CH}_2)_2\text{OH} \diagdown \end{array}$ | H | 3 | 83 | 169~171 | 51.64 51.39 | 5.10 5.12 | 24.80 24.41 | 14.42 14.16 |
| 13 | " | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{NCH}_3 \diagdown \end{array}$ | " | 4 | 97 | 141~142 | 52.59 52.62 | 4.96 4.96 | 26.84 27.02 | 15.60 15.42 |
| 14 | " | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{N} \begin{array}{c} \diagup \text{Ph} \diagdown \end{array} \diagdown \end{array}$ | " | " | 90 | 193~194 | 59.01 59.07 | 4.72 4.82 | 22.94 23.14 | 13.34 13.41 |
| 15 | " | $-\text{NH}_2$ | " | " | 74 | 256 | 46.81 | 3.21 | 29.78 | 20.20 |
| 16 | " | $-\text{NHCH} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_3 \end{array}$ | " | " | 90 | 175~176 | 51.85 51.80 | 4.66 4.66 | 25.92 25.95 | 17.58 17.57 |

| 例 | X | Y | Z | 合成法 (実施例例) | 収率 (%) | 融点 (°C) | C | H | N | F |
|----|---|---|---|---------------|-----------|---------|----------------|--------------|----------------|----------------|
| 17 | $-\text{CF}_3$ | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{COC}_2\text{H}_5 \end{array}$ | H | 4 | 88 | 260~262 | 51.90 51.56 | 4.61 4.38 | 24.93 24.86 | 14.49 14.63 |
| 18 | $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{NCOC}_2\text{H}_5 \end{array}$ | # | 2 | 88 | 218~220 | 63.77 63.92 | 7.49 7.68 | 24.79 24.67 | — — |
| 19 |  | $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{NCOC}_2\text{H}_5 \end{array}$ | # | 2 | 77 | 188~190 | 66.48 66.64 | 6.07 6.17 | 23.60 23.37 | — — |
| 20 | $-\text{CH}_3$ | $-\text{NHN}=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5$ | # | 4 | 65 | 268~270 | 65.24 65.29 | 5.17 5.28 | 29.59 30.11 | — — |

※ : B の元素分析値 計算値 8.47
実験値 8.33

出 願 人 三菱化成工業株式会社
代 理 人 弁理士 長谷川 一
(ほかノ名)

第 1 頁の続き

⑤ Int·Cl² 識別記号

(C 07 D 413/04
C 07 D 251/18
C 07 D 295/12)

⑦発 明 者 梅津浩平
町田市小川 2 丁目10番 3 号
同 戸部昭広
川崎市多摩区登戸3031番地
同 白坂正
川崎市高津区末長220番地
同 尾崎れい子
東京都大田区東雪ヶ谷 1 丁目34
番13号